

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2000-103784

(P2000-103784A)

(43)公開日 平成12年4月11日(2000.4.11)

(51)Int.Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	テマコード*(参考)
C 0 7 D 231/22		C 0 7 D 231/22	B 4 C 0 6 3
A 0 1 N 43/56		A 0 1 N 43/56	D 4 H 0 1 1
C 0 7 D 401/04	2 3 1	C 0 7 D 401/04	2 3 1

審査請求 未請求 請求項の数2 OL (全 8 頁)

(21)出願番号	特願平10-277584	(71)出願人	000005968 三菱化学株式会社 東京都千代田区丸の内二丁目5番2号
(22)出願日	平成10年9月30日(1998.9.30)	(72)発明者	岡田 至 神奈川県横浜市青葉区鴨志田町1000番地 三菱化学株式会社横浜総合研究所内
		(72)発明者	富田 啓文 神奈川県横浜市青葉区鴨志田町1000番地 三菱化学株式会社横浜総合研究所内
		(74)代理人	100103997 弁理士 長谷川 暁司 Fターム(参考) 4C063 AA01 BB02 CC22 DD12 EE03 4H011 AA01

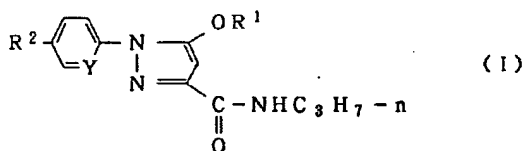
(54)【発明の名称】 5-アルコキシピラゾール-3-カルボキサミド誘導体およびこれを有効成分とする農薬

(57) 【要約】

【課題】 各種の植物病原菌に対し、高い防除効果を有する新しい化合物を提供する。

【解決手段】 下記一般式（Ⅰ）で示される5-アルコキシピラゾール-3-カルボキサミド誘導体

【化1】

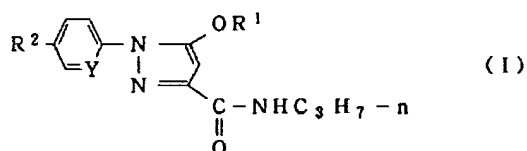


(式中、R<sup>1</sup> はアルキル、アリルまたはハロアルキル基を示す。R<sup>2</sup> はハロゲン原子、アルキル、ニトロ、シアノまたはトリフルオロメチル基を示す。)

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記一般式(Ⅰ)

【化1】



(式中、R<sup>1</sup> はC<sub>1</sub> ~C<sub>4</sub> のアルキル基、アリル基またはC<sub>1</sub> ~C<sub>4</sub> のハロアルキル基を示し、R<sup>2</sup> はハロゲン原子、C<sub>1</sub> ~C<sub>4</sub> のアルキル基、ニトロ基、シアノ基またはトリフルオロメチル基を示し、YはCHまたは窒素原子を示す)で表される5-アルコキシピラゾール-3-カルボキサミド誘導体。

【請求項2】 請求項1に記載の5-アルコキシピラゾール-3-カルボキサミド誘導体を有効成分として含有する農薬。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は新規な5-アルコキシピラゾール-3-カルボキサミド誘導体およびこれを有効成分として含有する農薬、特に殺菌剤に関する。

【0002】

【従来の技術】従来、農園芸分野では、各種病害の防除を目的とした様々な殺菌剤が開発され実用に供されている。しかしながら、従来汎用されている農園芸用殺菌剤は、殺菌効果、殺菌スペクトラムまたは残効性などの点において必ずしも満足すべきものではない。また、施用回数や施用量の低減などの要求も満足しているとはいえないものであった。

【0003】また、従来汎用の農薬に対して抵抗性を獲得した病原菌の出現も問題となっている。例えば、野菜、果樹、花卉、茶、ムギ類及びビネ等の栽培において、様々な型の農薬、例えば、トリアゾール系、イミダゾール系、ピリミジン系、ベンズイミダゾール系、ジカルボキシイミド系、フェニルアミド系農薬等に抵抗性を獲得した種々の病原菌が各地で出現しており、これらの病原菌に起因する各種病害の防除が年々困難になっている。

【0004】さらに、ジチオカルバメート系やフタルイミド系農薬等の様に病原菌が未だ抵抗性を獲得していない農薬もあるが、これらは一般に施用量や施用回数が多く、環境汚染などの観点から好ましいものではない。従って、従来汎用の農園芸用殺菌剤に抵抗性を獲得した各種病原菌に対しても低薬量で十分な防除効果を示し、しかも環境への悪影響が少ない新規な殺菌剤の開発が切望されている。

【0005】ピラゾールカルボキサミド誘導体は、ピラゾール環上の3個の置換基とカルボキサミド部分のアミノ基の種類により、それぞれ、殺虫、殺ダニ、殺菌、除

草活性あるいは医薬活性等の生理活性を有することが知られている。例えば1-フェニルピラゾール-3-カルボキサミド誘導体については、特開昭64-25763号には殺虫および殺ダニ活性を有するN-アラルキル-1-フェニルピラゾール-3-カルボキサミド誘導体が報告されている。除草剤の薬害軽減作用を有する物質として、特開昭63-91373号には、N-アラルキル-4-ハロゲノ-5-非置換-1-フェニルピラゾール-3-カルボキサミド誘導体が；特開平1-283274号公報には、N-アラルキル-4-非置換-5-アラルキル-1-フェニルピラゾール-3-カルボキサミド誘導体が；また、特開昭63-115867号にはN-アラルキル-4-非置換-1, 5-ジフェニルピラゾール-3-カルボキサミド誘導体が記載されているが、これらは殺菌活性については全く記載していない。また、除草活性を有するN-アラルキル-4-ハロゲノ-1, 5-ジフェニルピラゾール-3-カルボキサミドが特開平8-12654号公報に記載されているが殺菌活性については全く記載されていない。

【0006】さらに、医薬活性を有するN-アラルキル-4-非置換-5-アラルコキシ-1-フェニルピラゾール-3-カルボキサミド誘導体が薬学雑誌、97巻、719頁(1977)およびJournal of Medical Chemistry, 20巻、80頁(1977)に記載されているが農薬活性については全く記載されていない。また、N-メチル-4-ブromo-5-メトキシ-1-フェニルピラゾール-3-カルボキサミドが名古屋市立大学薬学部研究年報、29巻、25頁(1981)に記載されているが、医薬活性がないばかりか農薬活性については全く記載されていない。以上述べた様に5-アルコキシピラゾール-3-カルボキサミド誘導体の殺菌活性については全く報告がない。

【0007】

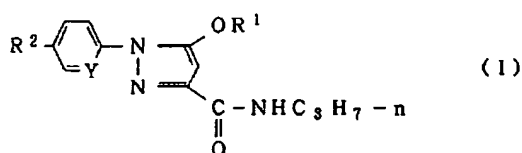
【発明が解決しようとする課題】本発明は、従来の農園芸用殺菌剤に抵抗性を示す各種病原菌に対しても高い防除効果を示し、かつ、残留毒性や環境汚染等の問題が軽減された安全性の高い、農園芸用殺菌剤の有効成分として有用な化学物質を提供することにある。

【0008】

【課題を解決するための手段】本発明者等は上記の課題を解決すべく鋭意努力した結果、下記の式で示される新規な5-アルコキシピラゾール-3-カルボキサミドにより上記の課題を解決し得ることを見出し、本発明を完成するに至った。すなわち本発明の要旨は、下記一般式(Ⅰ)

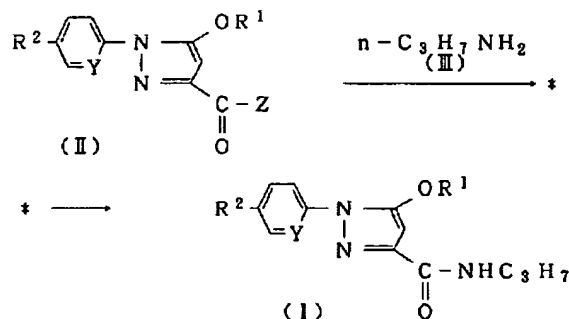
【0009】

【化2】



【0010】(式中、R<sup>1</sup> はC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> のアルキル基、アリル基またはC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> のハロアルキル基を示し、R<sup>2</sup> はハロゲン原子、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> のアルキル基、ニトロ基、シアノ基またはトリフルオロメチル基を示し、YはCHまたは窒素原子を示す)で表される5-アルコキシピラゾール-3-カルボキサミド誘導体およびこの化合物を有効成分として含有する農薬に存する。

【0011】前述の如く、医薬活性を有する5-アルコキシピラゾール-3-カルボキサミド誘導体は知られている。しかしながら、本発明と最も類似した薬学雑誌、97巻、719頁(1977)記載のN-アルキル-5-アルコキシ-1-置換フェニルピラゾール-3-カルボキサミド誘導体は、カルボキサミドのN-置換基として、メチル、ジメチル、ジイソプロピル、n-ブチル、2-ジエチルアミノエチル、エチル、ジエチル、sec-ブチル、2-ヒドロキシエチルの化合物が示されているが、N-アルキル基としてn-プロピル基の化合物は記載されていない。1-位の置換基としてピリジル基は



【0014】(上記式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> およびYは前記一般式(I)で定義したとおりであり、Zは塩素原子、臭素原子、水酸基、メトキシ基、エトキシ基またはプロポキシ基を示す。)

【0015】上記一般式(II)において、Zが塩素原子、臭素原子を示す場合には、溶媒としてベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類；クロロホルム、塩化メチレン等のハロゲン化炭化水素；水；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；またはテトラヒドロフラン、アセトニトリル、ジオキサン、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドンまたはジメチルスルホキシド等の極性溶媒等を用い、0℃~30℃、好ましくは0℃~5℃で塩基の存在下反応を行うことが出来る。塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、ピリジンまたはトリエチル

全く記載されていない。また、農薬活性については全く記載されていない。そして、後述の試験例から明らかな様にカルボキサミドのN-置換基がn-プロピル基である化合物は、N-置換基がメチル基である対応化合物に比し、卓越した農薬活性を有している。

#### 【0012】

【発明の実施の形態】一般式(I)において、R<sup>1</sup>としては具体的に、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基等の直鎖もしくは分岐のC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> のアルキル基；アリル基、ジフルオロメチル基、トリクロロメチル基、ペンタフルオロエチル基等のC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> のハロアルキル基が挙げられる。R<sup>2</sup> は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等のハロゲン原子；メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、シクロプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基等のC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> の直鎖、分岐鎖もしくは環状アルキル基、ニトロ基、シアノ基；トリフルオロメチル基が挙げられる。一般式(I)で示される化合物は、例えば下記反応式に従って製造することができる。

#### 【0013】

#### 【化3】

アミン等を用いることが出来る。

【0016】また、一般式(II)において、Zが水酸基、メトキシ基、エトキシ基、またはプロポキシ基である場合には、溶媒の非存在下、または、メチルアルコール、エチルアルコール、プロピルアルコール等のアルコール溶媒中で5~100℃、好ましくは20~80℃で反応を行うことが出来る。反応後、目的物である一般式(I)で表される化合物を単離するには、水に溶解する溶媒を用いた場合は、減圧下溶媒を留去し、水を加えた後、水に不溶のベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素；クロロホルム、塩化メチレン等のハロゲン化炭化水素等；酢酸エチル等のエステル類で抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウム等の乾燥剤で乾燥し、減圧下で溶媒を留去すれば良い。水に不溶の溶媒を用いた場合は、反応混合物に水を加えた後分液し有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウム等の乾燥

剤で乾燥後減圧下で溶媒を留去すればよい。

【0017】溶媒留去後得られた残渣はそのままでも十分純品であることもあるが、不純な場合には目的物を余り溶解しないヘキサン、ヘプタン等の炭化水素で洗浄するか、再結晶またはカラムクロマトグラフィーで精製すれば純品が得られる。また、一般式(II)で表される化合物は、例えば薬学雑誌、97巻、719頁(1977)およびJournal of Medical Chemistry, 20巻、80頁(1977)に記載された方法に準じて合成することができる。

【0018】一般式(I)で示される本発明化合物は、いもち病菌、さび病菌、べと病菌、疫病菌等の各種植物病原菌に対して高い殺菌効果を有しており、農薬、特に農園芸用殺菌剤の有効成分として有用である。もっとも、本発明の化合物の防除対象となる植物病原菌は上記に例示したものに限定されることはない。一般式(I)で示される本発明化合物を農薬、例えば農園芸用の殺菌剤として使用する場合には、単独で用いてもよいが、好ましくは当業界で汎用される農薬補助剤を加えた組成物として用いるのが好ましい。農園芸用殺菌剤の剤型は特に限定されないが、例えば乳剤、水和剤、粉剤、フロアブル剤、細粒剤、粒剤、錠剤、油剤、噴霧剤、煙霧剤等の形態とすることが好適である。上記の化合物の1種又は2種以上を有効成分として配合することができる。

【0019】農園芸用殺菌剤を製造するために用いられる農薬補助剤は例えば、農園芸用殺菌剤の効果の向上、安定化、分散性の向上等の作用を有する物質で、たとえば、担体(希釈剤)、展着剤、乳化剤、湿展剤、分散剤、崩壊剤等を用いることができる。液体担体としては、例えば水；トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素；メタノール、ブタノール、グリコール等のアルコール類；アセトン等のケトン類；ジメチルホルムアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類；メチルナフタレン；シクロヘキサン；動植物油；または脂肪酸等を挙げることができる。また、固体担体としては、例えばクレー、カオリン、タルク、珪藻土、シリカ、炭酸カルシウム、モンモリロナイト、ベントナイト、長石、石英、アルミナ、鋸屑、ニトロセルロース、デンブ、アラビアゴム等が挙げられる。乳化剤、分散剤としては通常の界面活性剤を使用することが出来、例えば、高級アルコール硫酸ナトリウム、ステアリルトリメチルアンモニウムクロライド、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ラウリルベタイン等の陰イオン系界面活性剤；陽イオン系界面活性剤；非イオン系界面活性剤；または両性イオン系界面活性剤等を用いることができる。また、ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンラウリルフェニルエーテル等の展着剤；ジアルキルスルホサクシネート等の湿展剤；カルボキシメチルセルロース、ポリビニルアルコール等の固着剤；リグニンスルホン酸ナトリウム、ラウリ

ル硫酸ナトリウム等の崩壊剤を用いることができる。

【0020】本発明の農園芸用殺菌剤における有効成分の含有量は、0.1～99.5%の範囲から選ばれ、製剤形態、施用方法等の種々の条件により適宜決定すればよいが、例えば、粉剤では約0.5～20重量%程度、好ましくは1～10重量%、水和剤では約1～90重量%程度、好ましくは10～80重量%、乳剤では約1～90重量%程度、好ましくは10～40重量%、フロアブル剤では約1～90重量%程度、好ましくは10～50重量%の有効成分を含有するように製造することが好適である。

【0021】例えば、乳剤の場合、有効成分である上記化合物に対して溶剤および界面活性剤等を混合して原液の乳剤を製造することが出来、さらにこの原液を、使用に際して、所定濃度に水で希釈して施用する。フロアブル剤の場合、有効成分である上記化合物に対して水および界面活性剤等を混合して原液を製造することが出来、さらにこの原液を使用に際して所定濃度に水で希釈して施用する。水和剤の場合、有効成分の上記化合物、固形担体及び界面活性剤等を混合して製造し、さらに使用に際して所定濃度に水で希釈して施用する。粉剤の場合、有効成分の上記化合物、固形担体等を混合してそのまま施用することができ、粒剤の場合には、有効成分の上記化合物、固形担体及び界面活性剤等を混合して造粒することにより製造し、そのまま施用することが出来る。もっとも、上記の各製剤形態の製造方法は上記のものに限定されることはなく、有効成分の種類や施用目的等に応じて当業者が適宜選択することができるものである。

【0022】本発明の農園芸用殺菌剤には、有効成分である本発明の化合物の活性を損なわない限り、他の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、昆虫生育調整剤、肥料、土壌改良剤等の任意の有効成分を配合してもよい。本発明の農園芸用殺菌剤の施用方法は特に限定されるものではなく、茎葉散布、水面施用、土壌処理、種子処理等のいずれの方法でも施用することが出来る。例えば、茎葉散布の場合、5～1,000ppm、好ましくは10～500ppmの濃度範囲の溶液を10アール当たり100～200L程度の施用量で用いることができる。水面施用の場合の施用量は通常、有効成分が5～15%の粒剤では10アール当たり1～10kgである。土壌処理の場合、5～1,000ppmの濃度範囲の溶液を1m<sup>2</sup>当たり1～10L程度の施用量で用いることができる。種子処理の場合、種子重量1kg当たり10～1,000ppmの濃度範囲の溶液を10～100ml程度施用処理することができる。

【0023】

【実施例】以下、本発明を実施例、製剤例及び試験例によりさらに具体的に説明するが、本発明はその要旨を越えない限り以下の例に限定されるものではない。なお、以下の実施例の出発物質の1部の製造例を参考例として

示す。

【0024】＜参考例1＞ 1-(4-クロロフェニル)-5-ジフルオロメトキシピラゾール-3-カルボン酸エチルの合成

乾燥エチルアルコール100ml中にクロロジフルオロメタンガス20.0gを吹き込み、1-(4-クロロフェニル)-5-ヒドロキシピラゾール-3-カルボン酸エチル10.0gと炭酸カリウム7.31gを加え、オートクレープ内で70℃、2時間加熱した。室温に冷却後、減圧下濃縮した。得られた残渣に水を加え酢酸エチルで抽出後、飽和食塩水で洗浄した。有機相を分液し、減圧下濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物である1-(4-クロロフェニル)-5-ジフルオロメトキシピラゾール-3-カルボン酸エチル7.51g、mp 94~95℃を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.41 (3H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 4.43 (2H, q,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 6.56 (1H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 6.60 (1H, s), 7.45 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ ), 7.60 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ )。

【0025】＜参考例2＞ 1-(4-シアノフェニル)-5-ジフルオロメトキシピラゾール-3-カルボン酸エチルの合成

参考例1と同様にして1-(4-シアノフェニル)-5-ヒドロキシピラゾール-3-カルボン酸エチルとクロロジフルオロメタンを反応させ、目的物、mp 137~138℃を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.42 (3H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 4.44 (2H, q,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 6.61 (1H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 6.62 (1H, s), 7.79 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ ), 7.88 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ )。

【0026】＜参考例3＞ 1-(5-クロロピリジン-2-イル)-5-メトキシピラゾール-3-カルボン酸エチルの合成

1-(5-クロロピリジン-2-イル)-5-ヒドロキシピラゾール-3-カルボン酸エチル29.6g、炭酸カリウム21.9gとジメチル硫酸17.0gをエタノール150ml中で5時間加熱還流した。減圧下濃縮後、残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を分液し、水、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下濃縮し、残渣をヘキサン-アセトンで洗浄し、目的物15.8g、mp 117~118℃を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.41 (3H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 4.03 (3H, s), 4.24 (2H, q,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 6.24 (1H, s), 7.95~8.07 (3H, m), 8.51 (1H, s)。

【0027】＜参考例4＞ 1-(5-トリフルオロメ

チルピリジン-2-イル)-5-メトキシピラゾール-3-カルボン酸エチルの合成

参考例3と同様にして1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-5-ヒドロキシピラゾール-3-カルボン酸エチルとジメチル硫酸を反応させ、目的物、mp 85~86℃を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.42 (3H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 4.06 (3H, s), 4.44 (2H, q,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 6.26 (1H, s), 7.95~8.08 (3H, m), 8.83 (1H, s)。

【0028】＜参考例5＞ 1-(4-シアノフェニル)-5-メトキシピラゾール-3-カルボン酸エチルの合成

参考例3と同様にして1-(4-シアノフェニル)-5-ヒドロキシピラゾール-3-カルボン酸エチルとジメチル硫酸を反応させ、目的物、mp 123~125℃を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm: 1.42 (3H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 4.04 (1H, s), 4.43 (2H, q,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 6.24 (1H, s), 7.73 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ ), 7.98 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ )。

【0029】＜実施例1＞ N-n-プロピル-1-(4-ブロモフェニル)-5-メトキシピラゾール-3-カルボキサミドの合成

1-(4-ブロモフェニル)-5-メトキシピラゾール-3-カルボン酸0.59gと塩化チオニル4mlを1時間加熱還流した。未反応の塩化チオニルを減圧留去後、残渣をトルエン10mlに溶解した。この溶液をn-プロピルアミン0.59gおよびトリエチルアミン1.01gのトルエン10ml溶液中に0~10℃で滴下した。滴下後室温で2時間攪拌した後、反応液を氷水に注ぎトルエンで抽出した。トルエン相を水、飽和食塩水の順で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、トルエンを減圧下に留去した。残渣をヘキサンで洗浄し、表-1記載の化合物(No. 3)を得た。融点は75~77℃であった。

【0030】＜実施例2＞ N-n-プロピル-1-(4-シアノフェニル)-5-メトキシピラゾール-3-カルボキサミドの合成

参考例5で得られた1-(4-シアノフェニル)-5-メトキシピラゾール-3-カルボン酸エチル0.54gをn-プロピルアミン2.36g中、室温で8時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、得られた残渣をヘキサンで洗浄し、表-1記載の化合物(No. 11)0.45gを得た。融点は146~147℃であった。

【0031】＜実施例3＞実施例1または実施例2の方法に準じて表-1記載の化合物を得た。

【0032】

【表1】

表-1

$  \begin{array}{c}  \text{R}^2 - \text{C}_6\text{H}_4 - \text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{OR}^1 \\ \diagdown \end{array} \\  \text{N} \\  \text{C} - \text{NHC}_3\text{H}_7 - n \\  \parallel \\  \text{O}  \end{array}  $				
化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	融点mp (℃)
1	CH <sub>3</sub>	Cl	CH	82-83
2	CH <sub>3</sub>	NC	N	132-134
3	CH <sub>3</sub>	Br	CH	75-77
4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH	78-79
5	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH	75-76
6	CH <sub>3</sub>	O <sub>2</sub> N	CH	160-161
7	CH <sub>3</sub>	Cl	N	71-72
8	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N	73-74
9	CH <sub>3</sub>	I	CH	71-73
10	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH	108-110
11	CH <sub>3</sub>	NC	CH	146-147
12	CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	Cl	CH	58-60
13	CHF <sub>2</sub>	Cl	CH	84-86
14	CHF <sub>2</sub>	NC	CH	117-119

【0033】＜製剤例1＞水和剤

本発明の化合物No. 9（以下、化合物No. は表-1の化合物No. に対応する。）を20重量部、カープレックス#80（ホワイトカーボン、塩野義製薬株式会社、商品名）20重量部、STカオリンクレ（カオリナイト、土屋カオリン社、商品名）52重量部、ソルボール9047K（アニオン性界面活性剤、東邦化学株式会社、商品名）5重量部、ルノックスP65L（アニオン性界面活性剤、東邦化学株式会社、商品名）3重量部を配合し、均一に混合粉碎して、有効成分20重量%の水和剤を得た。

【0034】＜製剤例2＞粉剤

本発明の化合物No. 11を2重量部、クレ（日本タルク社製）93重量部、カープレックス#80（ホワイトカーボン、塩野義製薬株式会社、商品名）5重量部を均一に混合粉碎して、有効成分2重量%の粉剤を製造した。

【0035】＜製剤例3＞乳剤

本発明の化合物No. 11を20重量部、キシレン35重量部およびジメチルホルムアミド30重量部からなる混合溶媒に溶解し、これらにソルボール3005X（非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤の混合物、

東邦化学株式会社、商品名）15重量部を加えて、有効成分20重量%の乳剤を得た。

【0036】＜製剤例4＞フロアブル剤

本発明の化合物No. 11を30重量部、ソルボール9047K 5重量部、ソルボンT-20（非イオン性界面活性剤、東邦化学株式会社、商品名）3重量部、エチレングリコール8重量部および水44重量部をダイノミル（シンマルエンタープライゼス社製）で湿式粉碎し、このスラリー状混合物に1重量%キサントガム（天然高分子）水溶液10重量部を加え、良く混合粉碎して、有効成分20重量%のフロアブル剤を得た。

【0037】＜試験例1＞イネいもち病に対する殺菌効果

直径6cmの樹脂製ポットで1ポット当たり10株のイネ（品種：アキニシキ）を育成した。製剤例3の処方に従って製剤した本発明の農園芸用殺菌剤（乳剤）を水で所定濃度に希釈し、上記のイネ（3～4葉期）に1ポット当たり10mlの割合で茎葉散布した。散布した薬液を風乾した後のイネに、オートミール培地で培養したイネいもち病菌（*Magnaporthe grisea*）の孢子懸濁液（ $5.0 \times 10^5$  孢子/ml）を噴霧接種し、25℃の温室に24時間保った。その後、温室内

(22~25℃)で7日間放置し、出現した病斑面積率 に対応する。  
を測定し、下式により防除価を算出した。結果を表-2 【0038】  
に示した。なお、化合物No. は表-1の化合物No. 【数1】

(無処理区1葉当りの病斑面積率) - (処理区1葉当りの病斑面積率)

防除価=

(無処理区1葉当りの病斑面積率)

×100 (%)

【0039】<比較試験例1>薬学雑誌、97巻、71  
9頁(1977)に記載される下記化合物を用い、試験  
例1と同様にいもち病菌に対する殺菌効果を試験した。  
結果を表-2に示した。

【0041】

【表2】

【0040】

【化4】

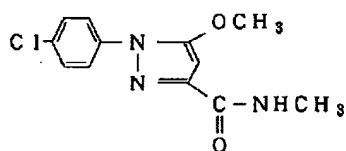


表-2

化合物No.	濃度 (ppm)	防除価 (%)
1	500	100
3	500	100
9	500	100
11	500	100
12	500	100
比較例1	500	0

【0042】<試験例2> トマト疫病に対する殺菌効果

直径6cmの樹脂製ポットで、1ポット当り3株のイネ  
(品種:レッドチェリー)を育成した。製剤例1の処方  
に従って製剤した化合物No. 11の農園芸用殺菌剤  
(水和剤)を水で500ppmに希釈し、上記のイネ  
(3~4葉期)に1ポット当り10mlの割合で茎葉散  
布した。散布した薬液を風乾した後のイネに、トマト切  
葉上で培養したトマト疫病菌 (*Phytophthora*  
*infestans*) の遊走子懸濁液 (5.0×  
10<sup>4</sup> 遊走子/ ml) を噴霧接種し、25℃の温室に  
24時間保った。その後、温室内 (20~22℃) で4

日間放置し、葉中に出現した病斑面積を測定し発病指数  
で示し、下記式により防除価を算出したところ、防除価  
は100%であった。

【0043】

【表3】

発病指数 0: 無病斑  
1: 病斑面積1/3以下  
3: 病斑面積1/3~2/3  
5: 病斑面積2/3以上

【0044】

【数2】

$$\text{発病度 (\%)} = \frac{0 \times n_0 + 1 \times n_1 + 3 \times n_3 + 5 \times n_5}{5 (n_0 + n_1 + n_3 + n_5)} \times 100$$

$n_x$ : 1ポット当りの、上記発病指数がxであるトマト  
の葉数

【0045】

【数3】

!(8) 000-103784 (P2000-登録)

$$\text{防除値} = \frac{\text{無処理区発病度} - \text{処理区発病度}}{\text{無処理区発病度}} \times 100$$

【0046】  
【発明の効果】本発明の5-アルコキシピラゾール-3-カルボキサミド類は、各種の植物病原菌に対して優れた防除効果を有し、農園芸用殺菌剤として有用である。